

Condensation products of alkyl-(oligo)glycosides and (hydroxy)-di- or tricarboxylic or sulfodicarboxylic acid or salt are used as deodorant in topical formulation for suppressing body odor and acne, especially cosmetic deodorant

Patent Number : DE10019752

International patents classification : A61K-007/32

• Abstract :

DE10019752 A NOVELTY - Condensation products (I) of 4-18 carbon (C)-alkyl-(oligo)saccharides (II), with 1-4 glycoside groups, and 3-6 C (hydroxy)-di- or tricarboxylic or sulfodicarboxylic acids (III) or their water-soluble salts are used as deodorants in topical formulations for suppressing body odor and acne.

DETAILED DESCRIPTION - Condensation products (I) of 4-18 carbon (C)-alkyl-(oligo)saccharides of formula (II), with 1-4 glycoside groups, and 3-6 C (hydroxy)-di- or tricarboxylic or sulfodicarboxylic acids (III) or their water-soluble salts are used as deodorants in topical formulations for suppressing body odor and acne.

RO(G)_n (II)

R = 4-18 C alkyl;

G = a glycoside residue; and

n = 1-4.

An INDEPENDENT CLAIM is also included for deodorant cosmetic compositions containing 0.1-10 wt.% (I) as deodorant component in an aqueous, emulsion, aqueous-alcoholic or water-free vehicle.

ACTIVITY - Antibacterial.

MECHANISM OF ACTION - None given.

USE - Condensation products (I) are used as deodorants in topical formulations for suppressing body odor and acne, especially in deodorant cosmetic compositions (all claimed).

ADVANTAGE - Strong antibacterials are detrimental to the bacterial flora of the skin or can cause irritation, whilst perfumes and absorbents are not usually effective enough. Esters (I) suppress body odor by inhibiting the growth of bacteria that decompose perspiration. (Dwg.0/0)

• Publication data :

Patent Family : DE10019752 A1 20011025 DW2002-04 A61K-007/32 5p * AP: 2000DE-1019752 20000420

Priority n° : 2000DE-1019752 20000420

Covered countries : 1

Publications count : 1

• Patentee & Inventor(s) :

Patent assignee : (HENK) HENKEL KGAA

Inventor(s) : BANOWSKI B; WADLE A

• Accession codes :

Accession N° : 2002-027289 [04]

Sec. Acc. n° CPI : C2002-007865

• Derwent codes :

Manual code : CPI: B04-C02X B07-A02B

B14-N17D D08-B09A E07-A02H

Derwent Classes : B04 D21 E13

Compound Numbers : 0053-09401-K 0053-

09401-T 0053-09401-U 0053-09402-K

0053-09402-T 0053-09402-U 0053-09401-

K 0053-09401-T 0053-09401-U 0053-

09402-K 0053-09402-T 0053-09402-U

• Update codes :

Basic update code :2002-04

Others :

Technology Abstract

TECHNOLOGY FOCUS

ORGANIC CHEMISTRY - Preferred

Condensate: The acid component (III) is citric, tartaric or sulfosuccinic acid or its water-soluble salt.

Preferred Composition: The cosmetic also contains 5-40 wt.% astringent, antiperspirant salt. In the case of water-free compositions, 5-40 wt.% astringent, antiperspirant salt, in the form of fine particles with an average size less than 100 microns, are impregnated or coated with 0.05-10 wt.% (I).

Keyword Index Terms

[1] 0053-09401-CL; 0053-09401-USE; 0053-09402-CL; 0053-09402-USE

UP4

2002-01

THIS PAGE BLANK (USPTO)



⑮ **BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND**



**DEUTSCHES
PATENT- UND
MARKENAMT**

⑫ **Offenlegungsschrift**
⑩ **DE 100 19 752 A 1**

⑤① Int. Cl.⁷:
A 61 K 7/32

⑲ Aktenzeichen: 100 19 752.3
⑳ Anmeldetag: 20. 4. 2000
㉓ Offenlegungstag: 25. 10. 2001

DE 100 19 752 A 1

⑦① Anmelder:
Henkel KGaA, 40589 Düsseldorf, DE

⑦② Erfinder:
Banowski, Bernhard, Dr., 40597 Düsseldorf, DE;
Wadle, Armin, Dr., 40699 Erkrath, DE

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

⑤④ Körperdeodorant

⑤⑦ Kondensationsprodukte aus Alkyl(oligo)sacchariden und gegebenenfalls hydroxysubstituierten Di- oder Tri-carbonsäuren oder einer Sulfodicarbonsäure mit 3-6 C-Atomen oder deren wasserlösliche Salze eignen sich als deodorierende Wirkstoffe in typischen Zubereitungen zur Unterdrückung von Körpergeruch. Die Kondensationsprodukte hemmen wirksam die Lebensfunktionen und die Vermehrung schweißzersetzender Keime, insbesondere von *Propionibacterium acnes* und *Corynebacterium Xerosis*.

DE 100 19 752 A 1

[0001] Die Erfindung betrifft die Verwendung von Kondensationsprodukten aus Alkyl(oligo)sacchariden und gegebenenfalls hydroxysubstituierten Di- oder Tricarbonsäuren oder Sulfodicarbonsäuren oder von deren wasserlöslichen Salzen als deodorierende, das Wachstum schweißersetzender Keime und Akne hemmende Wirkstoffe in topischen Zubereitungen zur Unterdrückung von Körpergeruch oder zur Aknebehandlung.

[0002] Der störende Geruch, der die Transpiration des Menschen begleitet, wird hauptsächlich durch die bakterielle Zersetzung des zunächst geruchlosen Schweißes auf der Haut und in der Kleidung verursacht. Man hat daher zur Unterdrückung des Körpergeruchs entweder schweißhemmende Präparate oder Stoffe eingesetzt, die das Wachstum oder die Lebensfunktionen der schweißersetzenden Keime beeinträchtigen.

[0003] Man hat auch versucht, den Körpergeruch durch Duftstoffe zu überdecken oder durch Absorbentien zu binden, solche Maßnahmen haben sich aber im allgemeinen als nicht ausreichend erwiesen.

[0004] Stark antibakterielle Stoffe wiederum haben den Nachteil, daß sie die Bakterienflora der Haut nachhaltig stören oder nicht ausreichend hautverträglich sind und auf diese Weise zu Imitationen und Unverträglichkeiten führen.

[0005] Es besteht daher ein ständiges Bedürfnis an Substanzen, die sich zur Verwendung als deodorierende, dermatologisch unbedenkliche, gut verträgliche Wirkstoffe zur Unterdrückung von Körpergeruch eignen. Es ist bekannt, daß die Schweißersetzung auf der Haut bevorzugt durch grampositive Keime, insbesondere durch sogenannte coryneforme Bakterien, z. B. das Corynebakterium Xerosis, verursacht werden.

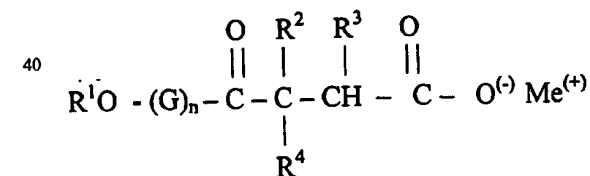
[0006] Es wurde nun gefunden, daß Kondensationsprodukte (Ester) von Alkyl(oligo)-sacchariden und Di- oder Tricarbonsäuren oder Sulfodicarbonsäuren oder deren wasserlösliche Salze als deodorierende, das Wachstum schweißersetzender Keime hemmende Wirkstoffe in topischen Zubereitungen zur Unterdrückung des Körpergeruchs geeignet sind.

[0007] Gegenstand der Erfindung ist daher die Verwendung von Kondensationsprodukten aus Alkyl(oligo)-sacchariden der Formel RO (G)_n, in der R eine Alkylgruppe mit 4–18 C-Atomen und (G)_n ein Glucosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1 bis 4 ist, und einer gegebenenfalls hydroxylsubstituierten Di- oder Tricarbonsäure oder einer Sulfodicarbonsäure oder von deren Salzen als deodorierende Wirkstoffe in topischen Zubereitungen zur Unterdrückung von Körpergeruch.

[0008] Kondensationsprodukte aus Alkyl(oligo)-glucosiden und Hydroxy-di- und -tricarbonsäuren oder Sulfodicarbonsäuren sind z. B. aus der Europäischen Patentschrift EP 0258814, B1 sowie aus der Fachliteratur (N. Bruns, Durg Cosmet. Ind. 160 (3), 42 (1977) und T. Verzotti et al. Cosmetic News XX-112, 29 (1997)) bekannt.

[0009] In einer bevorzugten Ausführung der Erfindung werden als deodorierende Wirkstoffe die Kondensationsprodukte aus Alkylglucosiden der Formel RO (G)_n, in der R eine Alkylgruppe mit 8–18 C-Atomen und (G)_n ein Glucosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1 bis 2 ist und einer Polycarbonsäure aus der Gruppe Citronensäure, Weinsäure und Sulfobernsteinsäure oder ein wasserlösliches Salz davon eingesetzt. Solche Kondensationsprodukte sind im Handel unter der Bezeichnung Eucarol® AGE-ET, Eucarol® AGE-EC und Eucarol® AGE-SS (Fa. Cesalpinia Chemicals) erhältlich. Es handelt sich dabei um 30%-ige bis 50%-ige wäßrige Lösungen der Natriumsalze von Kocosalkyl(oligo)glucosid-tartrat, Kocosalkyl(oligo)glucosid-citrat und Kocosalkyl(oligo)glucosid-sulfosuccinat.

[0010] Diese bevorzugt geeigneten Kondensationsprodukte folgen der allgemeinen Formel I



in der R¹ eine Alkylgruppe mit 8–18 C-Atomen, (G)_n der Rest eines (Oligo)-glucosids mit einem mittleren Oligomerisationsgrad n von 1–2, R² und R³ Wasserstoff oder eine Hydroxylgruppe oder durch eine Doppelbindung ersetzt sind und R⁴ Wasserstoff, eine -CH₂-COO⁽⁻⁾Me⁽⁺⁾ oder eine -SO⁽⁻⁾Me⁽⁺⁾-Gruppe ist, worin Me⁽⁺⁾ ein Alkali-, Magnesium-, Ammonium- oder Alkanolammoniumion ist.

[0011] Die erfindungsgemäß zu verwendenden Kondensationsprodukte werden bevorzugt als alleinige deodorierende Komponenten in deodorierenden kosmetischen Zubereitungen zur topischen Applikation eingesetzt. Ein weiterer Gegenstand der Erfindung ist daher eine deodorierende kosmetische Zubereitung zur topischen Applikation, die als deodorierende Komponente 0,1–10 Gew.-% eines Kondensationsproduktes aus Alkyl(oligo)sacchariden der Formel RO(G)_n, in der R eine Alkylgruppe mit 4–18 C-Atomen und (G)_n ein Glucosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1–4 ist, und einer gegebenenfalls hydroxysubstituierten Di- oder Tricarbonsäure oder einer Sulfodicarbonsäure mit 3–6 C-Atomen oder dessen wasserlöslichen Salzen in einem wäßrigen, emulsionsförmigen, wäßrig-alkoholischen oder wasserfreien Träger, gegebenenfalls mit einem Aerosol Treibmittel, enthält.

[0012] Um die besonderen Vorteile dieser Wirkstoffe zu nutzen, sollten ~Zie erfindungsgemäßen Zubereitungen bevorzugt frei von anderen antimikrobiellen Stoffen sein. Jedoch kann ein Gehalt anderer deodorierender Komponenten, z. B. esterasehemmender Wirkstoffe, antioxidativ oder adsorptiv wirkender Komponenten, Duftstoffen oder schweißhemmender, adstringierender (eiweißkoagulierender) Salze den deodorierenden Effekt weiter steigern.

[0013] Die als Träger geeigneten wäßrigen, emulsionsförmigen, wäßrig-alkoholischen oder wasserfreien Träger können flüssig, pastös oder fest sein. Es kann sich dabei um flüssige Lotionen oder niedrigviskose Emulsionen handeln, die aus Pumpzerstäubern oder mit Hilfe von Aerosol-Treibgasen auf die Haut gebracht werden. Es kann sich aber auch um verdickte Lotionen oder Emulsionen handeln, die aus Roll-on-Spendebehältern aufgetragen werden. Schließlich können die erfindungsgemäßen Zubereitungen auch als Salben oder Cremes oder als deodorierende Stiftpräparate oder deodorierende Seifen formuliert werden.

[0014] Die Formulierung wasserfreier Zubereitungen macht es erforderlich, daß auch die erfindungsgemäß zu verwenden-

denden Kondensationsprodukte in wasserfreier Form vorliegen. Diese lassen sich entweder durch Trocknung aus den wäßrigen Lösungen herstellen oder man setzt die sauren Kondensationsprodukte oder deren Alkanolammoniumsalze, die wasserfrei anfallen, ein.

[0015] Bevorzugt werden die erfindungsgemäß geeigneten Kondensationsprodukte in Kombination mit schweißhemmenden, adstringierenden Salzen in die Zubereitungen eingesetzt. In einer bevorzugten Ausführung enthalten die erfindungsgemäßen deodorierenden Zusammensetzungen adstringierende schweißhemmende Salze in einer Menge von 5–40 Gew.-% der Zusammensetzung. 5

[0016] Geeignete schweißhemmende Salze sind z. B. Aluminiumchlorid, Aluminiumchlorhydrat, Aluminiumdichlorhydrat, Aluminiumsesquichlorhydrat und deren Komplexe mit 1,2-Propylenglycol, Aluminiumhydroxyallantoinat, Aluminium-Zirkonium-tri- oder tetrachlorhydrat, Aluminium-Zirkonium-pentachlorhydrat und deren Komplexverbindungen mit Aminosäuren, z. B. mit Glycin. 10

[0017] In wasserfreien Zusammensetzungen werden die adstringierenden, schweißhemmenden Salze bevorzugt in Form feiner Teilchen einer mittleren Teilchengröße von weniger als 100 µm eingesetzt, die mit 0,005–10 Gew.-% (der Zusammensetzung) des Kondensationsprodukts imprägniert oder umhüllt sind. Die Umhüllung läßt sich z. B. dadurch erreichen, daß man eine wäßrige Lösung, die schweißhemmende, adstringierende Salze und Kondensationsprodukte gelöst enthält, durch Wasserentzug, z. B. durch Sprühtrocknung in ein Pulver überführt. In wäßrige, wäßrig-alkoholische und emulsionsförmige Zusammensetzungen erfolgt die Einarbeitung der Kondensationsprodukte durch Lösen in der wässrigen Phase. 15

[0018] Darüber hinaus können die erfindungsgemäßen deodorierenden Zubereitungen alle für die jeweilige Applikationsform erforderlichen Hilfsmittel und Zusätze enthalten, z. B. 20

- kosmetische Öle, Fette, Wachse oder Silikone
- Tenside und Emulgatoren
- niedere Alkohole mit 2–4 C-Atomen, Glycole, Glycolether und Polyole mit 2–6 C-Atomen
- Polyethylenglycole und andere wasserlösliche Polymere
- Celluloseether, Stärkederivate, Pflanzengumme und Biopolymere
- organophile Tone
- Farb- und Duftstoffe
- Komplexbildner
- Antioxydantien
- Adsorbentien wie Stärkepolver, Cellulose, Kieselsäure (Aerosil), Schichtsilikate wie Talkum, Hectorite, Montmorillonite
- esterasehemmende Stoffe, Wirkstoffe wie z. B. Triethylcitrat, Triacetin
- hautpflegende Stoffe wie z. B. Pflanzenextrakte, Feuchthaltemittel, Vitamine, Panthenol, Allantoin, u. a.

[0019] Die folgenden Beispiele sollen den Gegenstand der Erfindung näher erläutern: 35

Beispiele

1. Prüfung der bakteriellen Wachstumshemmung 40

[0020] 0,3 ml einer Lösung von Eucarol®, entsprechend 1 Gew.-% des Kondensationsprodukts, in Wasser wurde auf eine Filterpapierscheibe (d = 4,5 cm) aufgebracht und diese auf einen bakterienhaltigen Agar-Nährboden aufgelegt. Propionibacterium acnes, $9,3 \times 10^4$ KBE/ml Peptococcus Agar 45

bzw. Corynebacterium Xerosis, $2,4 \times 10^4$ KBE/ml Brain Heart Infusions Agar

[0021] Nach Inkubation wurde die Breite des gebildeten Hemmhofes (in mm) (bzw. der Zone mit reduziertem Wachstum) vermessen und das Wachstum unter der Filterpapierscheibe beurteilt. 50

kein Wachstum = 0°

deutlich gehemmtes Wachstum = 1

leicht gehemmtes Wachstum = 2

ungehemmtes Wachstum = 3

[0022] Es wurden folgende Ergebnisse erhalten:

	Propionibact.acnes		Corynebact. Xerosis	
	Hemmhof (mm)	Wachstum	Hemmhof (mm)	Wachstum
Eucarol ® AGE-EC	0	2	7-8	0
Eucarol ® AGE-ET	2	1	7-8	0
Eucarol ® AGE-SS	1	1	6-7	0

DE 100 19 752 A 1

2. Anwendungsbeispiele

2.1. Deodorant Pumpzerstäuber Rezepturen		(Angaben in Gew.-%)		
5	Ethanol 96 %-ig, (DEP vergällt)	55,0	55,0	55,0
	Triethylcitrat	3,0	3,0	3,0
	Hydriertes Rizinusöl 40 EO	0,5	0,5	0,5
10	a) Eucarol AGE-EC	3,0	----	----
	b) Eucarol AGE-ET	----	3,0	----
15	c) Eucarol AGE-SS	----	----	2,2
	Parfümöl	1,0	1,0	1,0
	Wasser	ad 100	ad 100	ad 100
20	2.2 Deodorant Rollon, Rezepturen		(Angaben in Gew.-%)	
	Ethanol 96 %-ig, (DEP vergällt)	30,0	30,0	30,0
25	Cetearylalkohol + 11EO	2,0	2,0	2,0
	Cetearylalkohol + 30 EO	2,0	2,0	2,0
30	Aluminiumhydroxychlorid	20,0	20,0	20,0
	Hydroxyethylcellulose	0,5	0,5	0,5
	a) Eucarol AGE-EC	3,0	----	----
35	b) Eucarol AGE-ET	----	3,0	----
	c) Eucarol AGE-SS	----	----	2,2
	Tocopherolacetat	0,1	0,1	0,1
40	Parfümöl	0,8	0,8	0,8
	Wasser	ad 100	ad 100	ad 100
45	2.3 Deodorant Stick, Rezepturen		(Angaben in Gew.-%)	
	Ethanol 96 %-ig, (DEP vergällt)	50,0	50,0	50,0
50	Palmitin/Stearinsäure 50/50	7,0	7,0	7,0
	Propylenglycol 1,2	33,0	33,0	33,0
55	Glycerin 86 %-ig	3,0	3,0	3,0
	Nationlauge 45%-ig	2,4	2,4	2,4
	a) Eucarol AGE-EC	3,0	----	----
60	b) Eucarol AGE-ET	----	3,0	----
	c) Eucarol AGE-SS	----	----	2,2
65	Parfümöl	1,0	1,0	1,0
	Wasser	ad 100	ad 100	ad 100

1. Verwendung von Kondensationsprodukten aus Alkyl(oligo)-sacchariden der Formel $RO(G)_n$, in der R eine Alkylgruppe mit 4–18 C-Atomen und $(G)_n$ ein Glycosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1 bis 4 ist, und einer gegebenenfalls hydroxysubstituierten Di- oder Tricarbonsäure oder einer Sulfodicarbonsäure mit 3–6 C-Atomen oder deren wasserlöslichen Salzen als deodorierende Wirkstoffe in topischen Zubereitungen zur Unterdrückung von Körpergeruch und Akne. 5
2. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß als deodorierende Wirkstoffe die Kondensationsprodukte an Alkylglucosiden der Formel $RO(G)_n$, in der R eine Alkylgruppe mit 8–18 C-Atomen und $(G)_n$ ein Glucosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1–4 ist und einer Polycarbonsäure aus der Gruppe Zitronensäure, Weinsäure und Sulfobernsteinsäure oder ein wasserlösliches Salz davon eingesetzt werden. 10
3. Deodorierende kosmetische Zusammensetzung, gekennzeichnet durch einen Gehalt von 0,1–10 Gew.-% eines Kondensationsproduktes aus Alkyl(oligo)-sacchariden der Formel $RO(G)_n$, in der R eine Alkylgruppe mit 4–18 C-Atomen und $(G)_n$ ein Glycosidrest mit einem Oligomerisationsgrad n von 1–4 ist, und einer gegebenenfalls hydroxysubstituierten Di- oder Tricarbonsäure oder einer Sulfodicarbonsäure mit 3–6 C-Atomen oder dessen wasserlöslichen Salzen als deodorierende Komponente in einem wäßrigen, emulsionsförmigen, wäßig-alkoholischen oder wasserfreien Träger. 15
4. Deodorierende kosmetische Zusammensetzung gemäß Anspruch 3, dadurch gekennzeichnet, daß sie zusätzlich adstringierende, schweißhemmende Salze in einer Menge von 5–40 Gew.-% der Zusammensetzung enthalten. 20
5. Deodorierende, kosmetische, wasserfreie Zusammensetzungen gemäß einem der Ansprüche 3 oder 4, dadurch gekennzeichnet, daß sie 5–40 Gew.-% adstringierender schweißhemmender Salze in Form feiner Teilchen einer mittleren Teilchengröße von weniger als 100 µm, die mit 0,05–10 Gew.-% des Kondensationsproduktes imprägniert oder umhüllt sind, enthalten. 25

25

30

35

40

45

50

55

60

65

THIS PAGE BLANK (USPTO)